

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年9月15日 (15.09.2005)

PCT

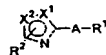
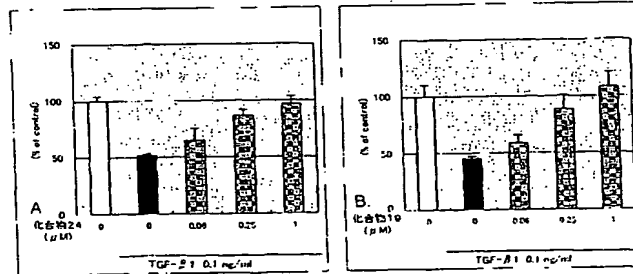
(10) 国際公開番号  
WO 2005/085241 A1

- (51) 国際特許分類: C07D 417/04, A61K 31/426, 31/427, 31/428, 31/4439, 31/454, 45/00, A61P 1/16, 11/00, 13/12, 17/14, 27/02, 43/00, C07D 277/24, 417/06, 417/14 // A61K 7/06
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/003755
- (22) 国際出願日: 2005年3月4日 (04.03.2005)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願2004-062321 2004年3月5日 (05.03.2004) JP  
特願2004-344307 2004年11月29日 (29.11.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 佐藤 正和 (SATO, Masakazu) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 松永 結子 (MATSUNAGA, Yuko) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 浅沼 肇 (ASANUMA, Hajime) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 天田 英明 (AMADA, Hideaki) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 小網 武史 (KOAMI, Takeshi) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 高山 哲男 (TAKAYAMA, Tetsuo) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 薮内 哲也 (YABUUCHI, Tetsuya) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 塩澤 史康 (SHIOZAWA, Fumiyasu) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目2番地1号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) Title: THIAZOLE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: チアゾール誘導体

A... COMPOUND 24  
B... COMPOUND 19

(57) Abstract: A thiazolylimidazole derivative represented by the formula (wherein  $X^1$  and  $X^2$  are different and each represents sulfur or carbon;  $R^1$  represents phenyl, substituted phenyl, phenyl fused with a heteroaromatic ring, pyridyl, or pyridyl fused with a heteroaromatic ring;  $R^2$  represents hydrogen, halogeno,  $C_{1-6}$  alkyl,  $C_{1-6}$  alkyl substituted by one to five halogen atoms,  $C_{1-6}$  alkoxy,  $C_{1-6}$  alkanoyl, or  $C_{1-3}$  hydroxyalkyl; and A represents a group represented by the following formula) or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative; and an ALK 5 inhibitor, therapeutic agent for alopecia, or hair restorer each containing the derivative or salt as an active ingredient. The derivative or salt is a substance inhibiting ALK 5, which is a TGF- $\beta$  type-I receptor. The hair growth preparation or hair restorer is based on a novel function.

[続葉有]



都豊島区高田3丁目24番地1号大正製薬株式会社内Tokyo (JP). 片貝 博典 (KATAKAI, Hironori) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目24番地1号大正製薬株式会社内Tokyo (JP). 梅宮 広樹 (UMEMIYA, Hiroki) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目24番地1号大正製薬株式会社内Tokyo (JP). 池田 明子 (IKEDA, Akiko) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田3丁目24番地1号大正製薬株式会社内Tokyo (JP).

(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA, Kiyoshi et al.); 〒1000004 東京都千代田区大手町2丁目2番1号新大手町ビル331 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,

NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

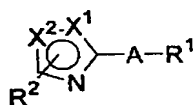
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

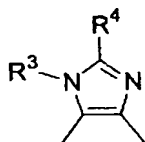
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

式



(式中、X<sup>1</sup>及びX<sup>2</sup>は相異なつて硫黄原子又は炭素原子を表し、R<sup>1</sup>はフェニル基;置換されたフェニル基;複素芳香環と縮合したフェニル基;ピリジル基;又は複素芳香環と縮合したピリジル基を示し、R<sup>2</sup>は水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数1〜6個のアルキル基、1〜5個のハロゲン原子で置換された炭素原子数1〜6個のアルキル基、炭素原子数1〜6個のアルコキシ基、炭素原子数1〜6個のアルカノイル基又は炭素原子数1〜5個のヒドロキシアルキル基を示し、Aは式



で示される基を示す。)で表されるチアゾリルイミダゾール誘導体又はその医薬上許容される塩、及びこれらを有効成分とするALK5阻害剤、脱毛症治療剤又は育毛剤。

本発明は、TGF-βのI型受容体であるALK5を阻害する物質の提供及び新規な作用に基づく脱毛剤又は育毛剤を提供するものである。